

25、W2189-02

SOLID PREPARATION CONTAINING TETOUSUTORE EXTRACT AS ACTIVE INGREDIENT**Publication number:** JP2001181195**Publication date:** 2001-07-03**Inventor:** ITO MASANORI**Applicant:** YAMADA SHINICHI**Classification:****- international:** A61K9/20; A61K47/36; A61P3/10; A61K9/20;
A61K47/36; A61P3/00; (IPC1-7): A61K35/78; A61K9/20;
A61K47/36; A61P3/10**- european:****Application number:** JP19990368110 19991224**Priority number(s):** JP19990368110 19991224**Report a data error here****Abstract of JP2001181195**

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a solid preparation which contains as an active ingredient the extract of *Bulnesia sarmienti* L. having been drawn and taken in the form of a tea, is epoch-making on a point for facilitating the intake, has a good quality because of containing a cellulosic substance, can contain a large amount of the extract solid content, and can easily be produced. **SOLUTION:** This solid preparation containing the extract of *Bulnesia sarmienti* L. as an active ingredient is characterized by further containing a cellulosic substance and process starch.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2001-181195

(P2001-181195A)

(43)公開日 平成13年7月3日(2001.7.3)

(51)Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テームト*(参考)
A 6 1 K 35/78		A 6 1 K 35/78	C 4 C 0 7 6
9/20		9/20	4 C 0 8 8
47/36		47/36	
47/38		47/38	
A 6 1 P 3/10		A 6 1 P 3/10	
審査請求 未請求 請求項の数4 O L (全 4 頁)			

(21)出願番号 特願平11-368110

(22)出願日 平成11年12月24日(1999. 12. 24)

(71)出願人 500230118

山田 伸一

愛知県犬山市大字橋爪字一丁田26番地3

(72)発明者 伊藤 正宣

神奈川県横浜市戸塚区俣野町1403-22-704

(74)代理人 100103436

弁理士 武井 英夫 (外1名)

Fターム(参考) 4C076 AA36 AA37 CC29 EE38A

EE41A FF04

4C088 AB99 BA09 CA05 MA34 MA35

MA52 NA10 ZC35

(54)【発明の名称】 テトウストレエキスを有効成分とする固形製剤

(57)【要約】

【解決手段】 セルロース類、さらに加工澱粉を含有することを特徴とするテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤。

【効果】 従来は煎じてお茶の形態で摂取していたテトウストレエキスを固形製剤化することにより、その摂取を容易にする点で画期的であり、またセルロース類を含有させることにより、固形製剤の品質は良好であり、多量のエキス固形分を含有させることが可能であるとともに、製造も容易という利点がある。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 セルロース類を含有することを特徴とするテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤。

【請求項 2】 さらに加工澱粉を含有することを特徴とする請求項 1 記載のテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤。

【請求項 3】 セルロース類が、結晶セルロース或いは粉末セルロースであることを特徴とする請求項 1 または 2 に記載のテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤。

【請求項 4】 錠剤であることを特徴とする請求項 1 ～ 3 のいずれかに記載のテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、メキシコを原産地とするブルネシア（別名「テトウストレ」）という樹木の樹皮を煎じて製したテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤に関する。

【0002】

【従来の技術】テトウストレの樹皮から抽出したエキスは、糖尿病の改善、予防に効果が認められている。その作用は膵臓の働きを円滑化することによって、インシュリンの分泌を促進させ、血中糖濃度を正常化するためと言われている。通常は、樹皮を煎じてお茶として摂取することが多い。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】しかし、簡便化のため、あるいは外出時等の服用を容易にするため、錠剤などの固形製剤とすることが望まれている。特に、できるだけエキス抽出分を多量に含有する固形製剤が望まれている。

【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、鋭意検討の結果、特定のセルロース類を用いることで、上記の課題が解決されることを見出し、本発明に至った。すなわち、本発明は、（1）セルロース類を含有することを特徴とするテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤、（2）さらに加工澱粉を含有することを特徴とするテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤、（3）セルロース類が結晶セルロース或いは粉末セルロースであることを特徴とするテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤、（4）錠剤であることを特徴とするテトウストレエキスを有効成分とする固形製剤に関する。

【0005】以下に本発明を詳細に説明する。本発明で用いるテトウストレエキスは、メキシコを原産とするブルネシアという樹木の樹皮を沸騰水等で抽出することにより得られる。まず、エキスの一般的な製法を述べる。通常、樹皮 1 重量部に対して、20 重量部程度の沸騰水を加え、5～30 分間煮沸してエキスを抽出する。より

抽出を完全にするために、液を濾過した後の樹皮に沸騰水を 3 重量部程度加えて、5～30 分間の二次抽出を行う。繰り返し抽出しても良いが、効率を考えると、抽出を 2～3 回繰り返す程度でよい。全ての濾液を回収した後、濃縮を行い、固形分 30% 程度のテトウストレエキスを得ることができる。必要に応じて、この段階で、90℃、30 分間程度の加熱殺菌処理を行っても良い。

【0006】本発明での固形製剤とは、錠剤状、顆粒状、粉末状、細粒状、散剤状等の形態をいう。錠剤は、円柱錠、カプレット錠、三角錠等の形状であり、それぞれの面は曲面を有していても良い。また、顆粒状、粉末状、細粒状、散剤状等の固形製剤をカプセルに充填しても良い。顆粒状、粉末状、細粒状、散剤状等の固形製剤は、先のテトウストレエキスをセルロース類と、あるいはセルロース類および加工澱粉を含有する添加剤と混合して、攪拌造粒法、流動層造粒法など通常用いられる方法で造粒し、必要により、乾燥、粉砕することにより得られる。エキスを大量に使用して、スラリー状とし、噴霧乾燥法によって粉末状とすることもできる。粉末状、散剤状にしたものについて、さらにセルロース類、加工澱粉などの添加剤を添加し、水あるいは含水アルコールなどを用いて造粒することにより、粒子径を大きくし、顆粒状にすることも可能である。

【0007】錠剤状の固形製剤は、顆粒状、粉末状、細粒状、散剤状等の固形製剤を通常の錠剤製造法により、そのまま、あるいは他の添加剤を添加した後、ロータリー式打錠機等により圧縮成形することにより得られる。錠剤の場合には、流通、保存時、ハンドリング時の摩擦を抑制するため、錠剤硬度は 2 kg 以上であることが好ましく、特に好ましくは 4 kg 以上である。また、服用後の吸収を促進するため、錠剤の崩壊時間は 60 分以内であることが好ましく、特に好ましくは 30 分以内である。

【0008】固形製剤中におけるテトウストレエキス固形分の含有量は、エキスの濃縮度合い、造粒方法、添加剤の種類、添加量等により左右されるので、一概には決定されないが、1～50 重量%の範囲が好ましい。1 重量%未満では、含有量が低いため効果が落ちる。50 重量%を超えると、造粒時にエキス量が多くなるため、造粒が困難となり、固形製剤の品質も充分なものではなくなる。10～25 重量%の範囲が特に好ましい。

【0009】本発明で言うセルロース類とは、結晶セルロース、粉末セルロース、セルロース誘導体などである。セルロース類は保水性に優れるため、エキスを固体状に加工することが容易であり、固形製剤を長期間保存してもべたつきなどが抑制され、品質がほとんど変化しないので、固形製剤化の担体として優れている。セルロース誘導体は、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルメロース、カルメロースカルシウム等である。置換基

を持たない結晶セルロース、粉末セルロースが好ましい。特に好ましくは、保水性、成形性、崩壊性などの製剤特性及び固形製剤品質の安定性に優れる結晶セルロースである。

【0010】セルロース類の添加量は、エキス固形分の含有量、製造方法、他の添加剤により異なり一概には決定されないが、1～60重量%の範囲が好ましい。1重量%未満では、セルロース類の製剤特性が有効に利用できない。60重量%を超えると、エキス固形分含量が制限される場合があり、また食感がやや悪くなるので好ましくない。特に好ましくは、10～40重量%の範囲である。

【0011】本発明で言う加工澱粉とは、通常の生澱粉を熱処理、機械処理などで処理することにより得られるアルファ化澱粉、部分アルファ化澱粉あるいはアセチル化処理などして得られるアセチル化澱粉などの澱粉誘導体である。特に、保水量、膨潤量が大きく、粘着性が低い特徴を有する部分アルファ化澱粉が好ましい。加工澱粉の添加量についても一概に決定されないが、1～40重量%の範囲が好ましい。特に好ましくは5～25重量%の範囲である。

【0012】他の添加剤としては、賦形剤、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、香料、着色料、甘味剤、界面活性剤などが挙げられ、これらを添加することが可能である。賦形剤としては、白糖、ブドウ糖、乳糖、果糖、マルトース、トレハロースなどの糖類、マンニトール、キシリトール、マルチトール、エリスリトール、ソルビトール等の糖アルコール類、とうもろこし澱粉、馬鈴薯澱粉等のデンプン類、リン酸水素カルシウム、炭酸カルシウム、無水ケイ酸、含水ケイ酸、ケイ酸アルミ、ケイ酸カルシウム、ケイ酸アルミン酸マグネシウム等の無機物類等が挙げられる。

【0013】結合剤としては、デンプン糊等のデンプン類、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー等の合成高分子類、アルギン酸ナトリウム、キサンタンガム、アラビアガム等の天然高分子類等が挙げられる。滑沢剤としては、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸、ショ糖脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、タルク、硬化菜種油等が挙げられる。甘味剤としては、上記の賦形剤としての糖類、糖アルコール類の他、アスパルテーム、ステビアなどの高度甘味料が挙げられる。

【0014】また、ポリデキストロース、難消化性デキストリンなどの食物繊維類、炭酸カルシウム、リン酸カルシウム、卵殻カルシウム、サンゴカルシウム、牛骨カルシウムなどのカルシウム類、炭酸マグネシウム、硫酸マグネシウムなどのマグネシウム類、ビタミン類、DHA、EPA等の不飽和脂肪酸類などの機能性食品素材を含有しても良い。

【0015】エキス成分は渋味があるので、味をマスキ

ングする目的で、必要に応じて、シェラックあるいはショ糖などの糖類、糖アルコール類、セルロース誘導体、ワックス類などを用いて、固形製剤にさらにコーティングを施しても構わない。コーティング方法は、通常の医薬品、健康食品で用いられる方法と同じで良い。すなわち、錠剤状であれば、コーティングパン、錠剤用コーティング機等を用い、顆粒状乃至粉末状であれば、流動層コーティング機、転動流動層コーティング機等を用いる。

10 【0016】

【発明の実施の形態】次に、実施例などを用いて本発明をさらに詳細に説明するが、本発明はこれら実施例などにより何ら限定されるものではない。なお、本発明での各種物性の測定は以下のとおり行った。

<錠剤硬度>シュロインゲル硬度計を用いて錠剤を破壊するのに必要な荷重を求め、錠剤5個の平均値を求めた。

<日局崩壊時間>日本薬局方13改正の崩壊時間測定法に従い、イオン交換水を用いて、6個の成型物の崩壊時間を測定し、その平均値を求めた。

20 【0017】

【実施例1】テトウストレ樹皮1重量部に、20重量部の沸騰水を加え、10分間煮沸した後、濾過した。残渣の樹皮に沸騰水3重量部を加え、10分間静置して、さらに二次抽出を行った後、濾過した。全ての濾液を回収した後、固形分濃度が30%になるまで減圧濃縮を行った。この液を密閉状態で、90℃で30分間の加熱殺菌処理を行い、テトウストレエキスを得た。

30 【0018】結晶セルロース（旭化成工業社製）60重量部にテトウストレエキス60重量部（固形分としては18重量部）を添加し、プラネタリーミキサーで15分間練合した。次に、50℃の熱風乾燥機中に1晩置き乾燥し、エキス固形分23%を含有する散剤状固形製剤を得た。この散剤状固形製剤を室内に放置したが、べたつきは感じられなかった。

【0019】

【実施例2】実施例1で得た散剤状固形製剤78重量部にショ糖脂肪酸エステル（三菱化学フーズ社製）2重量部を混合した後、ロータリー打錠機で直径10mm、重量300mgの円柱状錠剤に成形した。錠剤硬度は6kg、崩壊時間は10分と良好な品質の錠剤が得られた。

【0020】

40 【実施例3】実施例1で得た散剤状固形製剤78重量部に部分アルファ化澱粉15重量部を混合した。この混合物に、50%含水エタノールを20重量部添加し、プラネタリーミキサーで練合した。次に、50℃の熱風乾燥機中に1晩置き乾燥し、エキス固形分19%を含有する顆粒状固形製剤を得た。この顆粒状固形製剤を室内に放置したが、べたつきは感じられなかった。

50 【0021】

【実施例 4】散剤状固形製剤 78 重量部に替えて実施例 3 で得た顆粒状固形製剤 93 重量部を用いた以外は実施例 2 と同様な方法で打錠を行い、円柱状錠剤を得た。この錠剤の錠剤硬度は 8 kg、崩壊時間は 6 分と、良好な品質の錠剤が得られた。

【0022】

【実施例 5】実施例 1 で得たテトウストレエキス 50 重量部（固形分としては 15 重量部）、結晶セルロース 30 重量部、卵殻カルシウム 20 重量部、とうもろこしでんぷん 12 重量部、難消化性デキストリン 5 重量部をプラネタリーミキサーで 15 分間混合した後、50℃の熱風乾燥機で 1 晩乾燥し、エキス固形分を 17% 含有する顆粒状固形製剤を得た。続いて、パンタムミルを用いて、粉碎を行い、粉末状固形製剤を得た。

【0023】次に、粉末状固形製剤 87 重量部に部分アルファ化澱粉 10 重量部を混合した。この混合物に、50% 含水エタノールを 20 重量部添加し、プラネタリーミキサーで練合した。次に、50℃の熱風乾燥機中に 1 晩置き乾燥した後、硬化菜種油 3 重量部を加え、ロータリー打錠機で錠剤重量 250mg の三角錠に成形し、エキス固形分 15% を含有する錠剤状固形製剤を得た。この錠剤の硬度は 10 kg、崩壊時間は 18 分であった。

【0024】

【比較例 1】実施例 1 で得たテトウストレエキス 40 重量部に乳糖 60 重量部を添加して、実施例 1 と同様に操作し、エキス固形分 17% を含有の散剤状固形製剤の製造を試みたが、練合物は団子状の塊になり、散剤状固形製剤は得られなかった。

【0025】

【比較例 2】結晶セルロース 60 重量部に替え、とうもろこしでんぷん 60 重量部を用いた以外は実施例 1 と同様に操作して、テトウストレ含有散剤状固形製剤の製造を試みたが、粗大顆粒となった。パンタムミルで粉碎したところ、粉末状にはなったものの、放置により次第にべたつきを感じた。放置前の粉末を用い、実施例 2 に従い、打錠したが、硬度が低く、摩損度が高いという商品価値の低い錠剤しか得られなかった。

【0026】

【発明の効果】本発明によるテトウストレエキス含有固形製剤は、従来は煎じてお茶の形態で摂取していたテトウストレエキスを固形製剤化することにより、その摂取を容易にする点で画期的である。また、セルロース類を含有させることにより、固形製剤の品質は良好であり、多量のエキス固形分を含有させることが可能であるとともに、製造も容易という利点がある。